

(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



11212 1221

(43) 国際公開日 2003 年8 月28 日 (28.08.2003)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 03/070754 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07K 5/12, C12N 9/99, A61K 38/00, A61P 17/00, 31/00, 35/00, 37/00, 43/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP03/01859

(22) 国際出願日:

2003年2月20日(20.02.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2002-44000 2002年2月20日 (20.02.2002) J

(71) 出願人 および

- (72) 発明者: 吉田 稔 (YOSHIDA,Minoru) [JP/JP]; 〒334-0059 埼玉県 川口市 安行 6 5 5 2 1 Saitama (JP). 西野 憲和 (NISHINO,Norikazu) [JP/JP]; 〒808-0104 福岡県北九州市 若松区畠田 1 6 6 Fukuoka (JP). 堀之内末治 (HORINOUCHI,Sueharu) [JP/JP]; 〒135-0044東京都 江東区 越中島 1 3 1 6 4 0 3 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 清水 初志 , 外(SHIMIZU,Hatsushi et al.); 〒 300-0847 茨城県 土浦市 卸町 1 1 1 関鉄つくばビル 6 階 Ibaraki (JP).

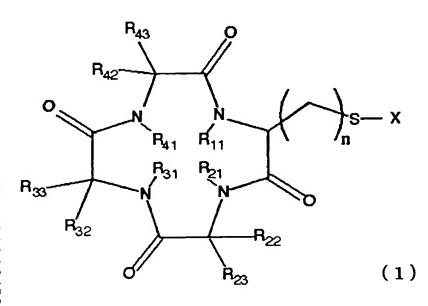
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

-- 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

- (54) Title: HISTONE DEACETYLASE INHIBITORS AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME
- (54) 発明の名称: ヒストン脱アセチル化酵素阻害剤およびその製造方法



(57) Abstract: Compounds represented by the following general formula (1) have a potent activity of selectively inhibiting HDAC1,4. Thus, these compounds are useful as drugs for preventing or treating diseases caused by HDAC1,4. (1)

7O 03/070754 A1

A.	A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ C07K5/12, C12N9/99, A61K38/00, A61P17/00, A61P31/00, A61P35/00, A61P37/00, A61P43/00			
Acco	ording to	International Patent Classification (IPC) or to both nat	tional classification and IPC	
		SEARCHED	1	
	Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁷ C07K5/12, C12N9/99, A61K38/00, A61P17/00, A61P31/00, A61P35/00, A61P37/00, A61P43/00			
		on searched other than minimum documentation to the		
Elec	etronic de REGI:	nta base consulted during the international search (name STRY (STN), CA (STN)	e of data base and, where practicable, sear	rch terms used)
C.	DOCUN	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Cate	egory*	Citation of document, with indication, where app		Relevant to claim No.
	A	WO 01/07042 A1 (MERCK & CO., 01 February, 2001 (01.02.01), & EP 1204411 A1 & JP		1-9
A COLETTI S.L. et al., Broad spectrum antip agents that inhibit histone deacetylase: structure-activity relationships of apici Part 2. Bioorg.Med.Chem.Lett. 2001, Vol.1 No.2, pages 113 to 117		deacetylase: nips of apicidin.	1-9	
	A COLETTI S.L. et al., Design and synthesis of histone deacetylase inhibitors: the development of apicidin transition state analogs. Tetrahedron Letters 2000, Vol.41, No.41, pages 7837 to 7841		1 - 9	
×	Furthe	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.	
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		ent defining the general state of the art which is not red to be of particular relevance document but published on or after the international filing ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is establish the publication date of another citation or other reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or other ent published prior to the international filing date but later e priority date claimed	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art document member of the same patent family Date of mailing of the international search report	
14 March, 2003 (14.03.03) 01 Ap			01 April, 2003 (01	.04.03)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		nailing address of the ISA/ nese Patent Office	Authorized officer	
Facsimile No.		D.	Telephone No.	

INTERNATION SEARCH REPORT

		101/01	
C (Continua	tion). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relev	ant passages	Relevant to claim No.
A	MEINKE P.T. et al., Synthesis of side characteristic desired apicidin derivatives: potent med based histone deacetylase inhibitors. Teletters 2000, Vol.41, No.41, pages 7831	ain chanism- trahedron	1-9
Α	<pre>JP 2001-316283 A (Fujisawa Pharmaceutica Ltd.), 13 November, 2001 (13.11.01), & CA 2317003 A1</pre>		1-9
· A	WO 00/52033 A1 (JAPAN ENERGY CORP.), 08 September, 2000 (08.09.00), & EP 1174438 A1 & US 2002/012009 & JP 2000-256397 A	99 Al	1-9
A	WO 00/21979 A1 (Fujisawa Pharmaceutical Ltd.), 20 April, 2000 (20.04.00), & EP 1123309 A2 & JP 2002-52744		1-9
			-



A.	発明の属する分野の分類	(国際特許分類	(IPC))
	•			

Int. C17 CO7K 5/12, C12N 9/99, A61K 38/00, A61P 17/00, A61P 31/00, A61P 35/00, A61P 37/00, A61P 43/00

調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. C1' C07K 5/12, C12N 9/99, A61K 38/00, A61P 17/00, A61P 31/00, A61P 35/00, A61P 37/00, A61P 43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN)

こ 関連オス	らと認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO 01/07042 A1 (MERCK &CO., INC.) 2001.02.01 & EP 1204411 A1 & JP 2003-505417 A	1-9
A	COLETTI S. L. et al, Broad spectrum antiprotozoal agents that inhibit histone deacetylase:structure-activity relationships of apicidin. Part 2. Bioorg. Med. Chem. Lett. 2001, Vol. 11, No. 2, p. 113-117	1-9
		ــــــــــــــــــــــــــــــــــــــ

|x| C欄の続きにも文献が列挙されている。

□ パテントファミリーに関する別紙を参照。

- * 引用文献のカテゴリー
- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日 以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する 文献(理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

- の日の後に公表された文献
- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって 出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論 の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに よって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査報告の発送日 01.04.03 国際調査を完了した日 14.03.03 9152 特許庁審査官(権限のある職員) 4 N 国際調査機関の名称及びあて先 富永 みどり 日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100-8915 電話番号 03-3581-1101 内線 3448

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

· ·	国際調査報告 国際出願番号	P JPU.	5/01833
(C (続き).	即油ナスト部分とわる文献		
引用文献の	関連すると認められる文献		関連する
カテゴリー*		5箇所の表示	請求の範囲の番号
A	COLETTI S. L. et al, Design and synthesis of histone deacetylase inhibitors: the development of apicidin transition state analogs. Tetrahedron Letters 2000, Vol. 41, No. 41, p. 7837-7841		1-9
A	MEINKE P.T. et al, Synthesis of side chain modified apicidin derivatives: potent mechanism-based histone deacetylase inhibitors. Tetrahedron Letters 2000, Vol. 41, No. 41, p. 7831-7835		1-9
A	JP 2001-316283 A(藤沢薬品工業株式会社)2001.11.13 & CA 2317003 A1		1-9
A	WO 00/52033 A1 (JAPAN ENERGY CORP.) 2000.09.08 & EP 1174438 A1 & US 2002/0120099 A1 & JP 2000-256397 A		1-9
A	WO 00/21979 A1(藤沢薬品工業株式会社)2000.04.20 & EP1123309 A2 & JP 2002-527449 A		1-9
	·		